

REC'D PCT/PTO 10 MAR 2005  
10/527 26

特 許 協 力 条 約

PCT

国際予備審査報告

REC'D 13 MAY 2004

WIPO PCT

(法第12条、法施行規則第56条)  
(PCT36条及びPCT規則70)

出願人又は代理人 の書類記号 3094WOOP	今後の手続きについては、国際予備審査報告の送付通知(様式PCT/ IPEA/416)を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JPO3/11511	国際出願日 (日.月.年) 09.09.2003	優先日 (日.月.年) 10.09.2002
国際特許分類 (IPC) Int. Cl <sup>7</sup> C07D263/32, 413/12, 413/14, 417/14, 417/12, 401/14, 403/12, C07F7/18, 9/6558, A61K31/422, 31/4439, 31/427, 31/4245, 31/454, 31/5377, 31/675, 31/695, 31/662, A61P3/06, 3/04, 3/10, 9/12, 43/00		
出願人 (氏名又は名称) 武田薬品工業株式会社		

1. 国際予備審査機関が作成したこの国際予備審査報告を法施行規則第57条 (PCT36条) の規定に従い送付する。
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 8 ページからなる。  <input type="checkbox"/> この国際予備審査報告には、附属書類、つまり補正されて、この報告の基礎とされた及び/又はこの国際予備審査機関に対してした訂正を含む明細書、請求の範囲及び/又は図面も添付されている。 (PCT規則70.16及びPCT実施細則第607号参照) この附属書類は、全部で ページである。
3. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。  I <input checked="" type="checkbox"/> 国際予備審査報告の基礎 II <input type="checkbox"/> 優先権 III <input checked="" type="checkbox"/> 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成 IV <input checked="" type="checkbox"/> 発明の単一性の欠如 V <input checked="" type="checkbox"/> PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明 VI <input checked="" type="checkbox"/> ある種の引用文献 VII <input type="checkbox"/> 国際出願の不備 VIII <input checked="" type="checkbox"/> 国際出願に対する意見

国際予備審査の請求書を受理した日 01.10.2003	国際予備審査報告を作成した日 21.04.2004	
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員)  中木 亜希	4 P 9282
電話番号 03-3581-1101 内線 3492		

様式PCT/IPEA/409 (表紙) (1998年7月)

## I. 国際予備審査報告の基礎

1. この国際予備審査報告は下記の出願書類に基づいて作成された。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に  
応答するために提出された差し替え用紙は、この報告書において「出願時」とし、本報告書には添付しない。  
PCT規則70.16, 70.17)

☒ 出願時の国際出願書類

- |                                     |   |  |        |                      |
|-------------------------------------|---|--|--------|----------------------|
| <input type="checkbox"/> 明細書        | 第 |  | ページ、   | 出願時に提出されたもの          |
| <input type="checkbox"/> 明細書        | 第 |  | ページ、   | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 明細書        | 第 |  | ページ、   | 付の書簡と共に提出されたもの       |
| <input type="checkbox"/> 請求の範囲      | 第 |  | 項、     | 出願時に提出されたもの          |
| <input type="checkbox"/> 請求の範囲      | 第 |  | 項、     | PCT19条の規定に基づき補正されたもの |
| <input type="checkbox"/> 請求の範囲      | 第 |  | 項、     | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 請求の範囲      | 第 |  | 項、     | 付の書簡と共に提出されたもの       |
| <input type="checkbox"/> 図面         | 第 |  | ページ/図、 | 出願時に提出されたもの          |
| <input type="checkbox"/> 図面         | 第 |  | ページ/図、 | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 図面         | 第 |  | ページ/図、 | 付の書簡と共に提出されたもの       |
| <input type="checkbox"/> 明細書の配列表の部分 | 第 |  | ページ、   | 出願時に提出されたもの          |
| <input type="checkbox"/> 明細書の配列表の部分 | 第 |  | ページ、   | 国際予備審査の請求書と共に提出されたもの |
| <input type="checkbox"/> 明細書の配列表の部分 | 第 |  | ページ、   | 付の書簡と共に提出されたもの       |

2. 上記の出願書類の言語は、下記に示す場合を除くほか、この国際出願の言語である。

上記の書類は、下記の言語である \_\_\_\_\_ 語である。

- ☐ 国際調査のために提出されたPCT規則23.1(b)にいう翻訳文の言語  
☐ PCT規則48.3(b)にいう国際公開の言語  
☐ 国際予備審査のために提出されたPCT規則55.2または55.3にいう翻訳文の言語

3. この国際出願は、ヌクレオチド又はアミノ酸配列を含んでおり、次の配列表に基づき国際予備審査報告を行った。

- ☐ この国際出願に含まれる書面による配列表  
☐ この国際出願と共に提出された磁気ディスクによる配列表  
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された書面による配列表  
☐ 出願後に、この国際予備審査(または調査)機関に提出された磁気ディスクによる配列表  
☐ 出願後に提出した書面による配列表が出願時における国際出願の開示の範囲を超える事項を含まない旨の陳述書の提出があった  
☐ 書面による配列表に記載した配列と磁気ディスクによる配列表に記載した配列が同一である旨の陳述書の提出があった。

4. 補正により、下記の書類が削除された。

- ☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 図面の第 \_\_\_\_\_ ページ/図

5. ☐ この国際予備審査報告は、補充欄に示したように、補正が出願時における開示の範囲を越えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c) この補正を含む差し替え用紙は上記1.における判断の際に考慮しなければならず、本報告に添付する。)

## Ⅲ. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

☐ 国際出願全体

☒ 請求の範囲 26, 28

理由:

☒ この国際出願又は請求の範囲 26, 28 は、国際予備審査をすることを要しない次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

請求の範囲 26 及び 28 に記載された発明は、治療による人体の処置方法に関するものである。

☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

☒ 請求の範囲 26, 28 について、国際調査報告が作成されていない。

2. スクレオチド又はアミノ酸の配列表が実施細則の附属書 C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を満たしていないので、有効な国際予備審査をすることができない。

☐ 書面による配列表が提出されていない又は所定の基準を満たしていない。

☐ 磁気ディスクによる配列表が提出されていない又は所定の基準を満たしていない。

## IV. 発明の単一性の欠如

1. 請求の範囲の減縮又は追加手数料の納付の求めに対して、出願人は、

- ☐ 請求の範囲を減縮した。
- ☐ 追加手数料を納付した。
- ☐ 追加手数料の納付と共に異議を申立てた。
- ☐ 請求の範囲の減縮も、追加手数料の納付もしなかった。

2. ☒ 国際予備審査機関は、次の理由により発明の単一性の要件を満たしていないと判断したが、PCT規則68.1の規定に従い、請求の範囲の減縮及び追加手数料の納付を出願人に求めないこととした。

3. 国際予備審査機関は、PCT規則13.1、13.2及び13.3に規定する発明の単一性を次のように判断する。

- ☐ 満足する。
- ☒ 以下の理由により満足しない。

請求の範囲1に記載された化合物に相当し、かつ、糖尿病等の治療に有用である化合物は、別紙の引用文献に記載されているようにこの国際出願の出願前においてすでに公知であることから、請求の範囲1にマーカッシュ形式で記載された化合物群は新規な共通の化学構造を有しない。したがって、請求の範囲1、16、22、25、27及び29には二以上の発明が記載されているものの、これらが単一の一般的発明概念を形成するように連関しているとは認められない。

4. したがって、この国際予備審査報告書を作成するに際して、国際出願の次の部分を、国際予備審査の対象にした。

☒ すべての部分

☐ 請求の範囲 \_\_\_\_\_ に関する部分

V. 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条（PCT35条(2)）に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性 (N)	請求の範囲	11, 12, 15, 18-21, 29	有
	請求の範囲	1-10, 13, 14, 16, 17, 22-25, 27	無
進歩性 (IS)	請求の範囲	11, 12, 15	有
	請求の範囲	1-10, 13, 14, 16-25, 27, 29	無
産業上の利用可能性 (IA)	請求の範囲	1-25, 27, 29	有
	請求の範囲		無

2. 文献及び説明 (PCT規則70.7)

1. WO 01/16111 A2 (ELI LILLY AND COMPANY) 2001.03.08
2. WO 01/00603 A1 (GLAXO GROUP LIMITED) 2001.01.04
3. WO 96/13264 A1 (ELI LILLY AND COMPANY) 1996.05.09
4. US 4171365 A (STERLING DRUG INC.) 1979.10.16
5. GB 2110211 A (F.HOFFMANN-LA ROCHE) 1983.06.15
6. Arzneimittel-Forsch., 1978, Vol.28, No.5, p.739-749
7. Arzneimittel-Forsch., 1978, Vol.28, No.3, p.351-366
8. JP 63-159373 A (日産化学工業株式会社) 1988.07.02
9. J.Med.Chem., 1986, Vol.29, No.6, p.1065-1080
10. US 4996216 A (BASF AKTIENGESELLSCHAFT) 1991.02.26
11. WO 01/38325 A1 (TAKEDA CHEMICAL INDUSTRIES, LTD.) 2001.05.31
12. US 6214842 B1 (MICHAEL S. MALAMAS) 2001.04.10
13. Chem.Pharm.Bull., 2002.01.01, Vol.50, No.1, p.100-111
14. J.Med.Chem., 2002.03.28, Vol.45, No.7, p.1518-1534

文献1には、高脂血症、非インシュリン依存性糖尿病、インシュリン感受性に関連する疾患等の治療薬として有用な化合物が記載されており、Example 2の化合物は本願式(I)の化合物に相当する。さらに、文献1には、Example 2の化合物が低血糖化作用を有することを裏付ける薬理試験結果も記載されている。

文献2には、高脂血症、糖尿病、インシュリン抵抗性、肥満等の治療薬として有用な化合物が記載されており、Example 83の化合物は本願式(I)の化合物に相当する。

文献3には、高脂血症、糖尿病等の治療に有用な化合物が記載されており、Example 6~8及び8Aの化合物は、本願の式(I)の化合物に相当する。さらに、文献3には、Example 6~8の化合物が血中グルコースを低下する作用を有することを裏付ける薬理試験結果も記載されている。

文献4には、抗ウィルス剤として有用な化合物が記載されており、Example 33の化合物は、本願の式(I)の化合物に相当する。

(続き有)

## VI. ある種の引用文献

## 1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
WO 03/015774 A1 [EX]	27. 02. 2003	15. 08. 2002	17. 08. 2001

## 2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--

## Ⅷ. 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

請求の範囲 1 は、非常に多数の化合物を包含している。しかしながら、PCT 6 条の意味において明細書に裏付けられ、また、PCT 5 条の意味において開示されているのは、クレームされた化合物のごくわずかな部分にすぎない。

よって、この国際予備審査報告は、明細書に裏付けられ、開示されている部分、すなわち、請求の範囲 1 の式において、 $R^1$  がオキサゾール、チアゾール、ピラゾール又はイミダゾール、 $X$  が結合手、 $Q$  が  $C_{1-6}$  アルキレン、 $Y$  が酸素原子、そして、 $Z$  が  $-(CH_2)_n-Z^1-$  又は  $-Z^1-(CH_2)_n-$  (ただし、 $Z^1$  が結合手でないもの) である化合物について示した。

補充欄 (いずれかの欄の大きさが足りない場合に使用すること)

第 V 欄の続き

文献5には、トリパノソーマ症の治療に有用な化合物が記載されており、Example 6の化合物は、本願の式(I)の化合物に相当する。さらに、文献5には、Example 6の化合物が殺トリパノソーマ活性を有することを裏付ける薬理試験結果も記載されている。

文献6に記載のNo. 183及び185の化合物は本願の式(I)の化合物に相当する。また、文献6には、No. 183の化合物は、原生動物の感染症に対して治療効果があることも記載されている。

文献7に記載のNo. 344の化合物は本願の式(I)の化合物に相当する。また、文献7には、No. 344の化合物が抗原生動物活性を有していることも記載されている。

文献8の化合物283及び284は本願の式(I)の化合物に相当する。

文献9の第1078頁右欄第59-61行に記載の化合物は本願の式(I)の化合物に相当する。

文献10のTable 1-3及び6には、本願の式(I)に包含される化合物が記載されている。

以上から、本願請求の範囲1-10, 13及び14に記載された発明は、文献1-10のいずれかにより新規性を有しておらず、本願請求の範囲16に記載された発明は、文献1, 3-7のいずれかにより新規性を有しておらず、本願請求の範囲17, 22-25及び27に記載された発明は文献1又は3により新規性を有しない。

また、文献1-3の記載から、上記化合物の高脂血症、肥満症等に対する治療効果を確認してみるとは当業者にとって容易に成し得ることであるから、本願請求の範囲18-21及び29に記載された発明は、文献1-3により進歩性を有しない。

そして、文献1-14のいずれにも、本願請求の範囲11, 12及び15に記載された化合物は記載も示唆もされておらず、該化合物に想到することが当業者にとって自明であったとも認められない。